

6

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
4. Dezember 2003 (04.12.2003)

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 03/099244 A1**

PCT

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61K 7/06, 7/48

Stefan [DE/DE]; Martin-Niemöller-Strasse 13, 22880  
Wedel (DE). **VENZKE, Kirsten** [DE/DE]; Novalisweg  
27, 22303 Hamburg (DE). **DIECK, Tom, Karen** [DE/DE];  
Albers-Schönberg-Stieg 11, 22307 Hamburg (DE). **BRE-  
ITENBACH, Ute** [DE/DE]; Rehmstr. 19, 22299 Hamburg  
(DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/05347

(22) Internationales Anmeldedatum:  
22. Mai 2003 (22.05.2003)

(25) Erfindungssprache: Deutsch

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BEIERSDORF AG**; Unnastr.  
48, Patentabteilung (6713), Unnastr. 48, 20245 Hamburg  
(DE).

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(81) Bestimmungsstaaten (national): JP, US.

(30) Angaben zur Priorität:  
102 23 486.8 27. Mai 2002 (27.05.2002) DE

(84) Bestimmungsstaaten (regional): europäisches Patent (AT,  
BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR,  
HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR).

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): **BEIERSDORF AG** [DE/DE]; Unnastr. 48, 20245  
Hamburg (DE).

**Veröffentlicht:**

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden  
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen  
eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-  
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-  
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der  
PCT-Gazette verwiesen.

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **STÄB, Franz** [DE/DE];  
Bäckerstr. 3, 21379 Echem (DE). **WOLBER, Rainer**  
[DE/DE]; Liepmannweg 11, 22399 Hamburg (DE).  
**BLATT, Thomas** [DE/DE]; Julius-Leber-Weg 8, 22880  
Wedel (DE). **KOLBE, Ludger** [DE/DE]; Wiesenstrasse  
16, 21255 Dohren (DE). **MUNDT, Claudia** [DE/DE];  
Holunderstrasse 89A, 28207 Bremen (DE). **GALLINAT,**

WO 03/099244 A1

(54) Title: COSMETIC AND/OR DERMATOLOGICAL PREPARATION COMPRISING 2,3-DIBENZYL BUTYROLACTONES

(54) Bezeichnung: KOSMETISCHE UND/ODER DERMATOLOGISCHE ZUBEREITUNG MIT 2,3-DIBENZYL BUTYROLACTONEN

(57) Abstract: The invention relates to a cosmetic and/or dermatological preparation containing one or more 2,3-dibenzylbutyrolactone derivatives and/or the glycosides thereof, in addition to optional additional cosmetic and/or dermatological active ingredients, auxiliary agents and additives.

(57) Zusammenfassung: Kosmetische und/oder dermatologische Zubereitung enthaltend ein oder mehrere 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside neben gegebenenfalls weiteren kosmetischen und/oder dermatologischen Wirk-, Hilfs- und Zusatzstoffen.

Kosmetische und/oder dermatologische Zubereitung mit 2,3-  
Dibenzylbutyrolactonen

5

Die vorliegende Erfindung betrifft eine kosmetische und/oder dermatologische Zubereitung enthaltend ein oder mehrere 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren - Glycoside neben gegebenenfalls weiteren kosmetischen und/oder  
10 dermatologischen Wirk-, Hilfs- und Zusatzstoffen.

15

Die Haut ist das größte Organ des Menschen. Sie erfüllt eine Vielzahl von Funktionen (z.B. Wärmeregulation, Sinnesorgan für Tast- und Wärmeempfinden, Barrierefunktion, Schutz vor Austrocknung).

Man kann die Haut in drei histologisch abgrenzbare Schichten unterteilen:

- Oberhaut (Epidermis)
- Lederhaut (Cutis, Corium, Dermis)
- Unterhaut (Subcutis)

20

Die äußerste Schicht bildet die Oberhaut (Epidermis). Als Grenzschicht bildet sie die eigentliche Schutzhülle gegenüber der Umwelt. Mit etwa einem Zehntel der Gesamtdicke ist sie gleichzeitig die dünnste Schicht der Haut. Die Epidermis ist ein stratifiziertes Gewebe, in dem die äußere Schicht, die Hornschicht (Stratum corneum), den für die  
25 Barrierefunktion bedeutenden Teil darstellt. Sie wird im Kontakt mit der Umwelt abgenutzt und befindet sich deshalb in einem ständigen Erneuerungsprozess, wobei nach außen kontinuierlich feine Schuppen abgegeben und von innen verhorntes Zell- und Lipidmaterial nachproduziert wird.

30 Unter der Epidermis liegt die Lederhaut, die auch als Corium oder Dermis bezeichnet wird. Die Hauptfunktion dieses mesodermalen Bindegewebes besteht in der Versorgung der Epidermis. Es wird aus elastischen, kollagenen und retikulären Fasern gebildet und weist eine große Anzahl an Plasma- und Mastzellen auf.

Die Unterhaut (Subcutis) besteht aus lockerem Bindegewebe mit mehr oder weniger zahlreich eingelagerten Fettzellen. Sie dient als Wärmeschutz, als mechanische Polsterung sowie als Speicher für Nährstoffe und Wasser.

- 5 Die chronologische Hautalterung wird z.B. durch endogene, genetisch determinierte Faktoren verursacht. In Epidermis und Dermis kommt es alterungsbedingt z.B. zu folgenden Strukturschäden und Funktionsstörungen, die auch unter den Begriff „Senile Xerosis“ fallen können:
- 10 a) Trockenheit, Rauigkeit und Ausbildung von Trockenheitsfältchen,  
b) Juckreiz und  
c) verminderte Rückfettung durch Talgdrüsen (z.B. nach Waschen).

- Exogene Faktoren, wie UV-Licht und chemische Noxen, können kumulativ wirksam sein und z.B. die endogenen Alterungsprozesse beschleunigen bzw. sie ergänzen. In
- 15 Epidermis und Dermis kommt es insbesondere durch exogene Faktoren z.B. zu folgenden Strukturschäden- und Funktionsstörungen in der Haut, die über Maß und Qualität der Schäden bei chronologischer Alterung hinausgehen:

- 20 d) Sichtbare Gefäßerweiterungen (Teleangiectasien, Cuperosis);  
e) Schlaffheit und Ausbildung von Falten;  
f) lokale Hyper-, Hypo- und Fehlpigmentierungen (z.B. Altersflecken);  
g) vergrößerte Anfälligkeit gegenüber mechanischem Stress (z.B. Rissigkeit) und  
h) Abnahme des Kollagengehaltes der Haut (z.B. durch verminderte Neisynthese
- 25 und/oder durch verstärkten Abbau) und/oder Störungen des Glykosaminoglykan und/oder Elastinstoffwechsels.

- Neben Hautalterungsprozessen kann das äußere Erscheinungsbild der Haut, sowie ihre Funktion durch ein Ungleichgewicht der Hautflora, verstärkter Resorption toxischer oder
- 30 allergener Stoffe oder durch Befall von hautfremden Mikroorganismen gestört und geschädigt werden. Als Folge dieser Beeinträchtigungen kann es zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

Bei unreiner Haut beispielsweise, als welche man den Übergangszustand zwischen der gesunden normalen und der krankhaft veränderten Aknehaut bezeichnet, produziert die Haut erhöhte Mengen an Talg (Seborrhoe). Dieser dient zahlreichen Mikroorganismen, insbesondere *Propionibacterium acnes* und *Pityrosporum*-Arten als idealer Nährboden.

- 5 Die Mikroorganismen zersetzen den Talg zu Glycerin und Fettsäuren, wodurch die Talgdrüsen zu erhöhter Produktion angeregt und die Follikelwandungen in der Haut angegriffen und zerstört werden. Dies ruft Entzündungen in der Haut (Pusteln, Knoten, Zysten) hervor, welche oft nur narbig ausheilen, wodurch das optische Erscheinungsbild des an unreiner Haut leidenden Menschen dauerhaft geschädigt wird.

10

Die Aufgabe der kosmetischen Hautpflege ist es, die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umwelteinflüsse (z. B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z. B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) zu stärken oder wiederherzustellen. Damit dient der Einsatz von Kosmetika der

15 Verlangsamung des Hautalterungsprozesses und der Pflege der natürlichen Hautflora.

- Nach dem Stande der Technik sind bereits eine Reihe von Produkten zur Pflege erschaffen, insbesondere gealterter Haut entwickelt worden. Sie enthalten z.B. Retinoide (Vitamin A-Säure und/oder deren Derivate) bzw. Vitamin A und/oder dessen Derivate. Ihre
- 20 Wirkung auf die Strukturschäden ist allerdings umfangsmäßig begrenzt. Darüber hinaus gibt es bei der Produktentwicklung erhebliche Schwierigkeiten, die Wirkstoffe in ausreichendem Maße gegen oxidativen Zerfall zu stabilisieren. Die Verwendung Vitamin A-Säure-haltiger Produkte bedingt darüber hinaus oft starke erythematöse Hautreizungen. Retinoide sind daher nur in geringen Konzentrationen einsetzbar.

25

- Auch zur Behandlung und Pflege unreiner Haut wurden nach dem Stande der Technik eine Vielzahl von Produkten entwickelt. Diese haben jedoch unter dem Problem der mangelhaften Ausbalancierung von Wirkung und Nebenwirkung zu leiden. Entweder wirken herkömmliche Produkte zu stark bakteriozid und entfettend, wodurch die gesunde
- 30 Hautflora in der Regel zerstört beziehungsweise die Haut stark ausgetrocknet wird, oder die Produkte sind zu wenig wirkungsvoll, um einen Behandlungserfolg in einer angemessenen Zeit zu gewährleisten.

Es war daher die Aufgabe der vorliegenden Erfindung, die Mängel des Standes der

Technik zu beseitigen oder zumindest zu lindern und eine kosmetische und/oder dermatologische Zubereitung zu entwickeln, die sowohl prophylaktisch als auch therapeutisch wirksam ist gegen alle Erscheinungsformen der Hautalterung und der unreinen Haut.

5

Überraschend gelöst wird die Aufgabe durch eine kosmetische und/oder dermatologische Zubereitung enthaltend ein oder mehrere 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside neben gegebenenfalls weiteren kosmetischen und/oder dermatologischen Wirk-, Hilfs- und Zusatzstoffen.

10

Die erfindungsgemäße Zubereitung ist hochwirksam gegen alle Alterserscheinungen der Haut. Die Entstehung von Fältchen und Falten sowie von Altersflecken wird deutlich unterdrückt. Bereits bestehende Fältchen und Falten werden zurückgebildet, erschlaffte Haut wird wieder gestrafft und bekommt ein frisches und jugendliches Aussehen.

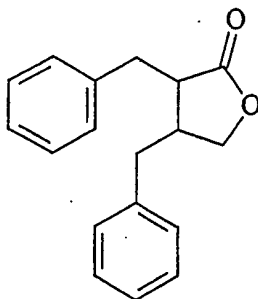
15

Bestehende Altersflecken können durch die Anwendung der erfindungsgemäßen Zubereitung zurückgebildet werden. Degenerierte Hautpartien werden regeneriert, Durchblutungsstörungen deutlich gemindert. Sogar Juckreiz und Stressempfinden der Haut lassen spürbar nach. Darüber hinaus eignet sich die erfindungsgemäße Zubereitung als wirkungsvolles und dennoch mildes Mittel zur Prophylaxe und Behandlung der unreinen

20

Haut und ihren krankhaften Auswüchsen in Form der Akne.

Die erfindungsgemäßen 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside leiten sich von dem ebenfalls erfindungsgemäßen 2,3-Dibenzylbutyrolacton ab, welches durch die folgende Struktur gekennzeichnet ist:



25

2,3-Dibenzylbutyrolacton

Erfindungsgemäß sind 2,3-Dibenzylbutyrolacton, 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside in all ihren stereoisomeren Formen, die sowohl als Racemat als auch in enantiomerenreiner Form, sowie in racemischen Gemischen mit unterschiedlichen Enantiomerenanteilen vorliegen können. Erfindungsgemäß umfasst die Formulierung 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside auch das 2,3-Dibenzylbutyrolacton.

Die erfindungsgemäße kosmetische und/oder dermatologische Zubereitung liegt dabei erfindungsgemäß bevorzugt in Form einer Emulsion vor. Die Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können dabei bevorzugt neben einer oder mehrerer Ölphasen zusätzlich eine oder mehrere Wasserphasen enthalten und beispielsweise in Form von W/O- (Wasser in Öl-), W/S- (Wasser in Silikonöl-), O/W- (Öl in Wasser-), S/W- (Silikonöl in Wasser-) Emulsion vorliegen. Ferner können sie erfindungsgemäß vorteilhaft auch in sogenannten multiplen Emulsionen wie beispielsweise W/O/W- oder O/W/O-Emulsionen vorliegen. Solche Formulierungen können vorzugsweise auch eine Mikroemulsion (z. B. eine PIT-Emulsion), eine Feststoff-Emulsionen (d. h. eine Emulsion, welche durch Feststoffe stabilisiert ist, z. B. eine Pickering-Emulsion), eine sprühbare Emulsion oder eine Hydrodispersion sein. Des Weiteren können die Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung auch nahezu wasserfrei sein (Wassergehalt unter 5 Gewichts-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung). Auch sind wässrige Lösungen erfindungsgemäß vorteilhaft. Erfindungsgemäß vorteilhaft sind die erfindungsgemäßen Zubereitungen auch in Form von Lipodispersionen, Gelen, festen Stiften oder Aerosolen.

Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können, z.B. in Form einer Crème, einer Lotion, einer kosmetischen Milch, einer Mousse-Creme aus einem Aerosolbehälter vorliegen.

Es ist auch möglich und vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, die erfindungsgemäßen 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside in wässrige Systeme bzw. Tensidzubereitungen zur Reinigung der Haut einzufügen.

Erfindungsgemäß beträgt die Konzentration ein oder mehrerer 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung vorteilhaft 0,001 bis 10 Gewichts-%, bevorzugt von 0,05 bis 5 Gewichts-

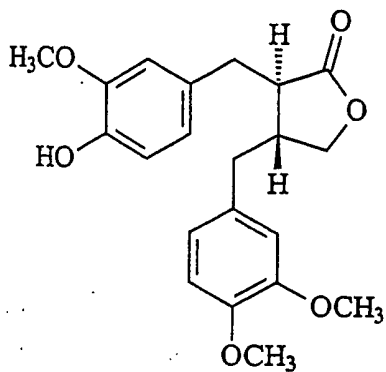
% und ganz besonders bevorzugt von 0,01 bis 2 Gewichts-%, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

- Die erfindungsgemäßen 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside können der erfindungsgemäßen Zubereitung vorteilhaft in Form von Pflanzenextrakten zugesetzt werden. Dabei haben sich wässrig-alkoholische Extrakte aus Pflanzen besonders bewährt. Jedoch sind auch mit anderen Extraktionsformen und Methoden gewonnene Extrakte und Destillate, beispielsweise mit Kohlendioxid als Extraktionsmittel gewonnene Extrakte sowie Wasserdampfdestillate, erfindungsgemäß vorteilhaft in die Zubereitungen einzuformulieren.

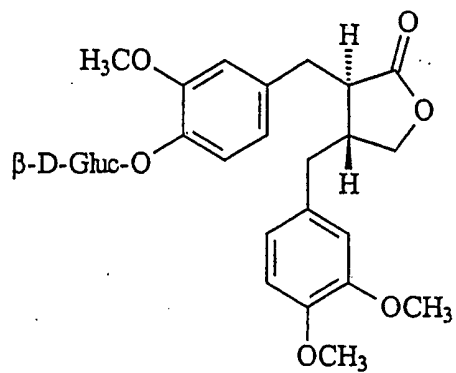
Es ist dabei erfindungsgemäß besonders vorteilhaft, Pflanzenextrakte von *Arctium lappa* L. (Große Klette) und/oder *Steganotaenia araliacea* (Carrot Tree) einzusetzen.

- Als erfindungsgemäß bevorzugte 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside werden Arctiin, Arctigenin, Prestegan B, Matairesinol, Trachelosid und/oder Trachelogenin eingesetzt.

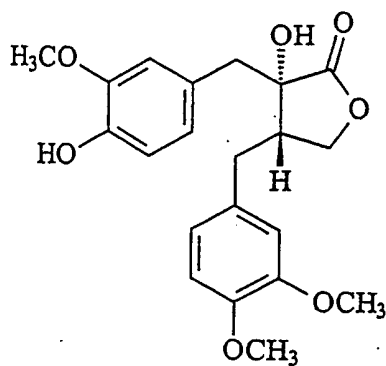
- Erfindungsgemäß besonders bevorzugt sind dabei die Derivate mit dem folgenden stereochemischen Aufbau:



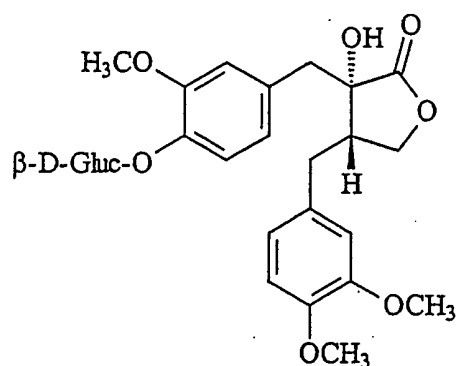
Arctigenin



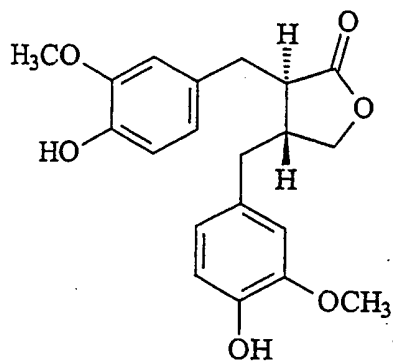
Arctiin



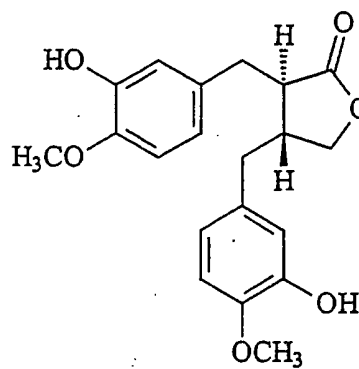
Trachelogenin



Trachelosid



Matairesinol



Prestegan B

Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt ist das Arctiin und das Prestegan B.



Die erfindungsgemäßen 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside lassen sich problemlos üblichen kosmetischen und/oder dermatologischen Zubereitungen, wie Lichtschutzzubereitungen, Hautpflegezubereitungen, Antifalten-

5 Zubereitungen, aber auch anderen Zubereitungen, beispielsweise pharmazeutischen Zubereitungen einverleiben.

Kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen enthalten in der Regel eine Vielzahl an Hilfs- und Wirkstoffen, die auch in den erfindungsgemäßen Zubereitungen

10 vorteilhafter Weise eingesetzt werden können.

Erfindungsgemäß können in den Zubereitungen, welche die 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside enthalten, die üblichen Antioxidantien eingesetzt werden.

15 Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z.B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z.B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z.B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z.B.  $\alpha$ -Carotin,  $\beta$ -Carotin, Lycopin)

20 und deren Derivate, Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z.B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-,  $\gamma$ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside

25 und Salze) sowie (Metall)-Chelatoren (z.B.  $\alpha$ -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin),  $\alpha$ -Hydroxysäuren (z.B. Citronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z.B.  $\gamma$ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Alanindiessigsäure, Flavonoide, Polyphenole,

30 Catechine, Vitamin C und Derivate (z.B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z.B. Vitamin-E-acetat), sowie Koniferylbenzoat des Benzoëharzes, Rutinsäure und deren Derivate, Ferulasäure und deren Derivate, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretsäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate,

Zink und dessen Derivate (z.B. ZnO, ZnSO<sub>4</sub>) Selen und dessen Derivate (z.B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z.B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

5

Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 10 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,025 - 2.0 Gew.-%, insbesondere 0.05 - 1.0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

10 Sofern Vitamin A bzw. Vitamin-A-Derivate, bzw. Carotine bzw. deren Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 bis 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

15 Sofern Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 bis 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

20 Weitere vorteilhafte Wirkstoffe im Sinne der vorliegenden Erfindung sind natürliche Wirkstoffe und/oder deren Derivate, wie z. B. alpha-Liponsäure, Phytoen, D-Biotin, Coenzym Q10, alpha-Glucosylrutin, Carnitin, Carnosin, natürliche und/oder synthetische Isoflavonoide, Kreatin, Kreatinin, Taurin und/oder  $\beta$ -Alanin, die bevorzugt in einer Konzentration von 0.001 bis 10 Gewichts-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung eingesetzt werden können. Vorteilhaft können auch Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt  
25 und/oder Soja-Extrakte und/oder Klee-Extrakte den erfindungsgemäßen Zubereitungen in einer Konzentration von 0,001 bis 10 Gewichts-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung zugefügt sein.

30 Erfindungsgemäße Rezepturen, welche z. B. bekannte Antifaltenwirkstoffe wie Flavonglycoside (insbesondere  $\alpha$ -Glucosylrutin), Coenzym Q10, Vitamin E und/oder Derivate und dergleichen enthalten, eignen sich insbesondere vorteilhaft zur Prophylaxe und Behandlung kosmetischer oder dermatologischer Hautveränderungen, wie sie z. B. bei der Hautalterung auftreten (wie beispielsweise Trockenheit, Rauigkeit und Ausbildung von Trockenheitsfältchen, Juckreiz, verminderte Rückfettung (z. B. nach dem Waschen),

sichtbare Gefäßerweiterungen (Teleangiectasien, Cuperosis), Schlaffheit und Ausbildung von Falten und Fältchen, lokale Hyper-, Hypo- und Fehlpigmentierungen (z. B. Altersflecken), vergrößerte Anfälligkeit gegenüber mechanischem Stress (z. B. Rissigkeit) und dergleichen). Weiterhin vorteilhaft eignen sie sich zur Behandlung und Prophylaxe des klinischen Erscheinungsbildes der trockenen bzw. rauhen Haut sowie zur Behandlung und Prophylaxe der Symptome UV-Licht induzierter Hautalterung (engl. Photoaging).

Es ist dem Fachmanne natürlich bekannt, dass anspruchsvolle kosmetische Zusammensetzungen zumeist nicht ohne die üblichen Hilfs- und Zusatzstoffe denkbar sind. Die erfindungsgemäßen kosmetischen und/oder dermatologischen Zubereitungen können kosmetische Hilfsstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z. B. Emulgatoren, Konservierungsmittel, Konservierungshelfer, Bakterizide, Parfüme, UV-Lichtschutzfilter, die Haut bleichende Mittel, Selbstbräuner, Repellentien, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die eine färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, anfeuchtende und/oder feuchthaltende Substanzen, Füllstoffe, die das Hautgefühl verbessern, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel oder Silikonderivate.

Medizinische topische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung enthalten in der Regel ein oder mehrere Medikamente in wirksamer Konzentration. Der Einfachheit halber wird zur sauberen Unterscheidung zwischen kosmetischer und medizinischer Anwendung und entsprechenden Produkten auf die gesetzlichen Bestimmungen der Bundesrepublik Deutschland verwiesen (z.B. Kosmetikverordnung, Lebensmittel- und Arzneimittelgesetz).

Vorteilhaft können erfindungsgemäße Zubereitungen außerdem Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z.B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 6,0 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar dienen.

Enthalten die erfindungsgemäßen Zubereitungen UVB-Filtersubstanzen, können diese öllöslich oder wasserlöslich sein. Erfindungsgemäß vorteilhafte öllösliche UVB-Filter sind z.B.:

- 5 - 3-Benzylidencampher-Derivate, vorzugsweise 3-(4-Methylbenzyliden)campher, 3-Benzylidencampher;
- 4-Aminobenzoësäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoësäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoësäureamylester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- 10 - Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Salicylsäurehomomenthylester,
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- 15 - Ester der Benzalmonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmonsäuredi(2-ethylhexyl)ester,
- 2,4,6-Triänilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin.

20 Vorteilhafte wasserlösliche UVB-Filter sind z.B.:

- Salze der 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure wie ihr Natrium-, Kalium- oder ihr Triethanolammonium-Salz, sowie die Sulfonsäure selbst;
- Sulfonsäure-Derivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure und ihre Salze;
- 25 - Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z.B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und ihre Salze sowie das 1,4-di(2-oxo-10-Sulfo-3-bornylidenmethyl)-Benzol und dessen Salze (die entsprechenden 10-Sulfato-Verbindungen, beispielsweise das entsprechende Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salz), auch als Benzol-1,4-di(2-oxo-3-bornylidenmethyl-10-Sulfonsäure bezeichnet,
- 30 - Hydroxybenzophenon-Derivate, wie z.B. 2-(4-Diethylamino-2-hydroxybenzoyl)-benzoic acid hexylester, welches beispielsweise von der Firma BASF unter dem Handelsnamen Uvinul® A Plus erhältlich ist.

- Benzoxazol-Derivate, wie z.B. das 2,4-bis-[5-1(dimethylpropyl)benzoxazol-2-yl-(4-phenyl)-imino]-6-(2-ethylhexyl)-imino-1,3,5-triazine (CAS-Nr.: 288254-16-0), welches beispielsweise unter dem Handelsnamen UVASorb® K2A von der Firma 3V Sigma erhältlich ist.

5

Die Liste der genannten UVB-Filter, die in Kombination mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen verwendet werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

- 10 Es kann auch von Vorteil sein, UVA-Filter einzusetzen, die üblicherweise in kosmetischen Zubereitungen enthalten sind. Bei diesen Substanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-tert. Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion. Weiterhin vorteilhafte UVA-Filter entstammen der Gruppe der Triazine, so z.B. das 2,4-  
15 Bis-[[4-(2-Ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin (Handelsbezeichnung Tinosorb® S) sowie der Gruppe der Triazole, wie z.B. das 2,2'-Methylen-bis- [6-2H-benzotriazol-2yl]-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)phenol (Handelsbezeichnung Tinosorb® M). Ein vorteilhafter wasserlöslicher UVA-Filter stellt das 2'-bis-(1,4-Phenyl)-1H-benzimidazol-4,6-disulfonsäure-Natriumsalz dar (Handelsbezeichnung  
20 Neo Heliopan AP®).

Es können die für die UVB-Kombination verwendeten Mengen eingesetzt werden.

- Erfindungsgemäße kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen enthalten vorteilhaft außerdem anorganische Pigmente auf Basis von Metalloxiden und/oder  
25 anderen in Wasser schwerlöslichen oder unlöslichen Metallverbindungen, insbesondere der Oxide des Titans ( $\text{TiO}_2$ ), Zinks ( $\text{ZnO}$ ), Eisens (z.B.  $\text{Fe}_2\text{O}_3$ ), Zirkoniums ( $\text{ZrO}_2$ ), Siliziums ( $\text{SiO}_2$ ), Mangans (z.B.  $\text{MnO}$ ), Aluminiums ( $\text{Al}_2\text{O}_3$ ), Cers (z.B.  $\text{Ce}_2\text{O}_3$ ), Mischoxiden der entsprechenden Metalle sowie Abmischungen aus solchen Oxiden. Besonders bevorzugt handelt es sich um Pigmente auf der Basis von  $\text{TiO}_2$ .

30

Es ist besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, wenngleich nicht zwingend, wenn die anorganischen Pigmente in hydrophober Form vorliegen, d.h., dass sie oberflächlich wasserabweisend behandelt sind. Diese Oberflächenbehandlung kann darin

bestehen, dass die Pigmente nach an sich bekannten Verfahren mit einer dünnen hydrophoben Schicht versehen werden.

5 Eines solcher Verfahren besteht beispielsweise darin, dass die hydrophobe Oberflächenschicht nach einer Reaktion gemäß



10 erzeugt wird.  $n$  und  $m$  sind dabei nach Belieben einzusetzende stöchiometrische Parameter,  $\text{R}$  und  $\text{R}'$  die gewünschten organischen Reste. Beispielsweise in Analogie zu DE-OS 33 14 742 dargestellte hydrophobisierte Pigmente sind von Vorteil.

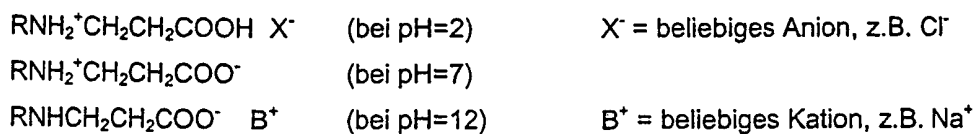
Vorteilhafte  $\text{TiO}_2$ -Pigmente sind beispielsweise unter den Handelsbezeichnungen MT 100 T von der Firma TAYCA, ferner M 160 von der Firma Kemira sowie T 805 von der Firma  
15 Degussa erhältlich.

Erfindungsgemäße Zubereitungen können, zumal wenn kristalline oder mikrokristalline Festkörper, beispielsweise anorganische Mikropigmente in die erfindungsgemäßen Zubereitungen eingearbeitet werden sollen, auch anionische, nichtionische und/oder  
20 amphotere Tenside enthalten. Tenside sind amphiphile Stoffe, die organische, unpolare Substanzen in Wasser lösen können.

Bei den hydrophilen Anteilen eines Tensidmoleküls handelt es sich meist um polare funktionelle Gruppen, beispielsweise  $-\text{COO}^-$ ,  $-\text{OSO}_3^{2-}$ ,  $-\text{SO}_3^-$ , während die hydrophoben Teile  
25 in der Regel unpolare Kohlenwasserstoffreste darstellen. Tenside werden im allgemeinen nach Art und Ladung des hydrophilen Molekülteils klassifiziert. Hierbei können vier Gruppen unterschieden werden:

- anionische Tenside,
- 30 • kationische Tenside,
- amphotere Tenside und
- nichtionische Tenside.

Anionische Tenside weisen als funktionelle Gruppen in der Regel Carboxylat-, Sulfat- oder Sulfonatgruppen auf. In wässriger Lösung bilden sie im sauren oder neutralen Milieu negativ geladene organische Ionen. Kationische Tenside sind beinahe ausschließlich durch das Vorhandensein einer quaternären Ammoniumgruppe gekennzeichnet. In wässriger Lösung bilden sie im sauren oder neutralen Milieu positiv geladene organische Ionen. Amphotere Tenside enthalten sowohl anionische als auch kationische Gruppen und verhalten sich demnach in wässriger Lösung je nach pH-Wert wie anionische oder kationische Tenside. Im stark sauren Milieu besitzen sie eine positive und im alkalischen Milieu eine negative Ladung. Im neutralen pH-Bereich hingegen sind sie zwitterionisch, wie das folgende Beispiel verdeutlichen soll:



Typisch für nicht-ionische Tenside sind Polyether-Ketten. Nicht-ionische Tenside bilden in wässrigem Medium keine Ionen.

#### A. Anionische Tenside

Vorteilhaft zu verwendende anionische Tenside sind

Acylaminosäuren (und deren Salze), wie

1. Acylglutamate, beispielsweise Natriumacylglutamat, Di-TEA-palmitoylaspartat und Natrium Caprylic/ Capric Glutamat,
2. Acylpeptide, beispielsweise Palmitoyl-hydrolysiertes Milchprotein, Natrium Cocoyl-hydrolysiertes Soja Protein und Natrium-/ Kalium Cocoyl-hydrolysiertes Kollagen,
3. Sarcosinate, beispielsweise Myristoyl Sarcosin, TEA-lauroyl Sarcosinat, Natrium-lauroylsarcosinat und Natriumcocoylsarcosinat,
4. Taurate, beispielsweise Natriumlauroyltaurat und Natriummethylcocoyltaurat,
5. AcylLactylate, lauroyllactylat, Caproyllactylat
6. Alaninate

Carbonsäuren und Derivate, wie

1. Carbonsäuren, beispielsweise Laurinsäure, Aluminiumstearat, Magnesiumalkanolat und Zinkundecylenat,

2. Ester-Carbonsäuren, beispielsweise Calciumstearoyllactylat, Laureth-6 Citrat und Natrium PEG-4 Lauramidcarboxylat,
3. Ether-Carbonsäuren, beispielsweise Natriumlaureth-13 Carboxylat und Natrium PEG-6 Cocamid Carboxylat,

5

Phosphorsäureester und Salze, wie beispielsweise DEA-Oleth-10-Phosphat und Dilau-reth-4 Phosphat,

Sulfonsäuren und Salze, wie

- 10 1. Acyl-isethionate, z.B. Natrium-/ Ammoniumcocoyl-isethionat,
2. Alkylarylsulfonate,
3. Alkylsulfonate, beispielsweise Natriumcocosmonoglyceridsulfat, Natrium C<sub>12-14</sub> Ole-fin-sulfonat, Natriumlaurylsulfoacetat und Magnesium PEG-3 Cocamidsulfat,
- 15 4. Sulfosuccinate, beispielsweise Dioctylnatriumsulfosuccinat, Dinatriumlaurethsulfo-succinat, Dinatriumlaurylsulfosuccinat und Dinatriumundecylenamido MEA-Sulfo-succinat

sowie

Schwefelsäureester, wie

- 20 1. Alkylethersulfat, beispielsweise Natrium-, Ammonium-, Magnesium-, MIPA-, TIPA-Laurethsulfat, Natriummyrethsulfat und Natrium C<sub>12-13</sub> Parethsulfat,
2. Alkylsulfate, beispielsweise Natrium-, Ammonium- und TEA- Laurylsulfat.

#### B. Kationische Tenside

25 Vorteilhaft zu verwendende kationische Tenside sind

1. Alkylamine,
2. Alkylimidazole,
3. Ethoxylierte Amine und
4. Quaternäre Tenside.
- 30 5. Esterquats

Quaternäre Tenside enthalten mindestens ein N-Atom, das mit 4 Alkyl- oder Arylgruppen kovalent verbunden ist. Dies führt, unabhängig vom pH Wert, zu einer positiven Ladung. Vorteilhaft sind, Alkylbetain, Alkylamidopropylbetain und Alkyl-amidopropylhydroxysulfain.



- Die erfindungsgemäß verwendeten kationischen Tenside können ferner bevorzugt gewählt werden aus der Gruppe der quaternären Ammoniumverbindungen, insbesondere Benzyltrialkylammoniumchloride oder -bromide, wie beispielsweise Benzyltrimethylstearyl-  
ammoniumchlorid, ferner Alkyltrialkylammoniumsalze, beispielsweise  
5 Cetyltrimethylammoniumchlorid oder -bromid, Alkyldimethylhydroxyethylammonium-  
chloride oder -bromide, Dialkyldimethylammoniumchloride oder -bromide, Alkylamidethyl-  
trimethylammoniumethersulfate, Alkylpyridiniumsalze, beispielsweise Lauryl- oder Cetyl-  
pyrimidiniumchlorid, Imidazolinderivate und Verbindungen mit kationischem Charakter  
wie Aminoxide, beispielsweise Alkyldimethylaminoxide oder Alkylaminoethyl-dimethyl-  
10 aminoxide. Vorteilhaft sind insbesondere Cetyltrimethylammoniumsalze zu verwenden.

#### C. Amphotere Tenside

Vorteilhaft zu verwendende amphotere Tenside sind

1. Acyl-/dialkylethylendiamin, beispielsweise Natriumacylamphoacetat, Dinatriumacyl-  
15 amphodipropionat, Dinatriumalkylamphodiacetat, Natriumacylamphohydroxypropyl-  
sulfonat, Dinatriumacylamphodiacetat und Natriumacylamphopropionat,
2. N-Alkylaminosäuren, beispielsweise Aminopropylalkylglutamid, Alkylaminopropion-  
säure, Natriumalkylimidodipropionat und Lauroamphocarboxyglycinat.

#### 20 D. Nicht-ionische Tenside

Vorteilhaft zu verwendende nicht-ionische Tenside sind

1. Alkohole,
2. Alkanolamide, wie Cocamide MEA/ DEA/ MIPA,
3. Aminoxide, wie Cocoamidopropylaminoxid,
- 25 4. Ester, die durch Veresterung von Carbonsäuren mit Ethylenoxid, Glycerin, Sorbitan  
oder anderen Alkoholen entstehen,
5. Ether, beispielsweise ethoxylierte/propoxylierte Alkohole, ethoxylierte/ propoxylier-  
te Ester, ethoxylierte/ propoxylierte Glycerinester, ethoxylierte/ propoxylierte Chole-  
sterine, ethoxylierte/ propoxylierte Triglyceridester, ethoxyliertes propoxyliertes  
30 Lanolin, ethoxylierte/ propoxylierte Polysiloxane, propoxylierte POE-Ether und  
Alkylpolyglycoside wie Laurylglucosid, Decylglycosid und Cocoglycosid.
6. Sucroseester, -Ether
7. Polyglycerinester, Diglycerinester, Monoglycerinester
8. Methylglucosester, Ester von Hydroxysäuren

Vorteilhaft ist ferner die Verwendung einer Kombination von anionischen und/oder amphoteren Tensiden mit einem oder mehreren nicht-ionischen Tensiden.

- 5 Die oberflächenaktive Substanz kann in einer Konzentration zwischen 1 und 30 Gew.-% in den erfindungsgemäßen Zubereitungen vorliegen, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Die kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen gemäß der Erfindung können wie üblich zusammengesetzt sein und zur Behandlung, Pflege und Reinigung der Haut und/oder der Haare und als Schminkprodukt in der dekorativen Kosmetik dienen. Entsprechend können sie, je nach ihrem Aufbau, beispielsweise verwendet werden als Hautschutzcrème, Reinigungsmilch, Sonnenschutzlotion, Nährcrème, Tages- oder Nachtcrème usw. Es ist gegebenenfalls möglich und vorteilhaft, die Zubereitungen gemäß der Erfindung als Grundlage für pharmazeutische Formulierungen zu verwenden.

- 15 Die erfindungsgemäßen Zubereitungen enthalten z.B. 0,001 bis 30 Gew.-%, bevorzugt 0,01 Gew.-% bis 10 Gew.-%, insbesondere aber 0,1 Gew.-% bis 5 Gew.-%, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen an den erfindungsgemäßen Wirkstoffen.

- 20 Bei kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen zum Schutze der Haare vor UV-Strahlen gemäß der Erfindung handelt es sich beispielsweise um Shampooierungsmittel, Zubereitungen, die beim Spülen der Haare vor oder nach der Shampooierung, vor oder nach der Dauerwellbehandlung, vor oder nach der Färbung oder Entfärbung der Haare angewendet werden, um Zubereitungen zum Fönen oder
- 25 Einlegen der Haare, Zubereitungen zum Färben oder Entfärben, um eine Frisier- und Behandlungslotion, einen Haarlack oder um Dauerwellmittel.

Die Lipidphase der erfindungsgemäßen kosmetischen und/oder dermatologischen Zubereitungen kann vorteilhaft gewählt werden aus folgender Substanzgruppe:

- 30 - Mineralöle, Mineralwachse
- Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, ferner natürliche Öle wie z.B. Rizinusöl;
- Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z.B. mit Isopropanol, Propy-

lenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;

- Alkylbenzoate;
- Silikonöle wie Dimethylpolysiloxane, Diethylpolysiloxane, Diphenylpolysiloxane sowie Mischformen daraus.

5

Die Ölphase der Zubereitung der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyleat, n-Butylstearat, n-Hexyllaurat, n-Decyloleat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononylisononanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyloleat, Oleylerucat, Erucyloleat, Erucylerucat sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, z.B. Jojobaöl.

10

15

20 Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Silikonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z.B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnussöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

25

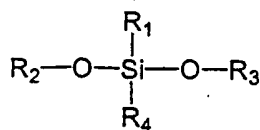
30 Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Iseicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether, Dicaprylylcarbonat.

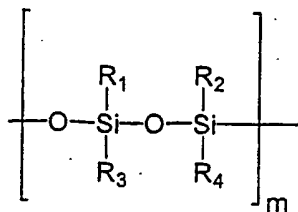
5. Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

- 10 Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

- 15 Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an zyklischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden. Solche Silicone oder Siliconöle können als Monomere vorliegen, welche in der Regel durch Strukturelemente charakterisiert sind, wie folgt:



Als erfindungsgemäß vorteilhaft einzusetzenden linearen Silicone mit mehreren Siloxyleinheiten werden im allgemeinen durch Strukturelemente charakterisiert wie folgt:

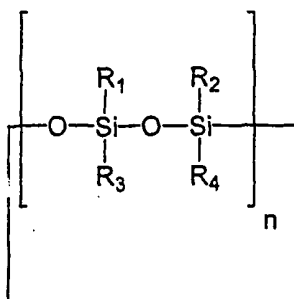


20

wobei die Siliziumatome mit gleichen oder unterschiedlichen Alkylresten und/oder Arylresten substituiert werden können, welche hier verallgemeinernd durch die Reste R<sub>1</sub> - R<sub>4</sub> dargestellt sind (will sagen, dass die Anzahl der unterschiedlichen Reste nicht notwendig auf bis zu 4 beschränkt ist). m kann dabei Werte von 2 - 200.000 annehmen.

25

Erfindungsgemäß vorteilhaft einzusetzende zyklische Silikone werden im allgemeinen durch Strukturelemente charakterisiert, wie folgt



wobei die Siliziumatome mit gleichen oder unterschiedlichen Alkylresten und/oder Arylresten substituiert werden können, welche hier verallgemeinernd durch die Reste  $R_1 - R_4$  dargestellt sind (will sagen, dass die Anzahl der unterschiedlichen Reste nicht notwendig auf bis zu 4 beschränkt ist).  $n$  kann dabei Werte von  $3/2$  bis 20 annehmen. Gebrochene Werte für  $n$  berücksichtigen, dass ungeradzahlige Anzahlen von Siloxylgruppen im Zyklus vorhanden sein können.

Vorteilhaft wird Cyclomethicon (z.B. Decamethylcyclopentasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Undecamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan), Cetyldimethicon, Behenoxydimethicon.

Vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, sowie solche aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

Es ist aber auch vorteilhaft, Silikonöle ähnlicher Konstitution wie der vorstehend bezeichneten Verbindungen zu wählen, deren organische Seitenketten derivatisiert, beispielsweise polyethoxyliert und/oder polypropoxyliert sind. Dazu zählen beispielsweise Polysiloxan-polyalkyl-polyether-copolymere wie das Cetyl-Dimethicon-Copolyol, das (Cetyl-Dimethicon-Copolyol (und) Polyglyceryl-4-Isostearat (und) Hexyllaurat)

Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

Die wässrige Phase der erfindungsgemäßen Zubereitungen enthält gegebenenfalls vorteilhaft Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl-

oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte, ferner Alkohole niedriger C-Zahl, z.B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin sowie insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliziumdioxid, Aluminiumsilikate.

Erfindungsgemäßen Zubereitungen enthalten insbesondere vorteilhaft ein oder mehrere Hydrokolloide. Diese Hydrokolloide können vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der Gumen, Polysaccharide, Cellulosederivate, Schichtsilikate, Polyacrylate und/oder anderen Polymeren.

Erfindungsgemäße als Hydrogele vorliegenden Zubereitungen enthalten ein oder mehrere Hydrokolloide. Diese Hydrokolloide können vorteilhaft aus der vorgenannten Gruppe gewählt werden.

Zu den Gumen zählt man Pflanzen- oder Baumsäfte, die an der Luft erhärten und Harze bilden oder Extrakte aus Wasserpflanzen. Aus dieser Gruppe können vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung gewählt werden beispielsweise Gummi Arabicum, Johannisbrotmehl, Tragacanth, Karaya, Guar Gummi, Pektin, Gellan Gummi, Carrageen, Agar, Algine, Chondrus, Xanthan Gummi.

Weiterhin vorteilhaft ist die Verwendung von derivatisierten Gumen wie z.B. Hydroxypropyl Guar (Jaguar® HP 8).

Unter den Polysacchariden und -derivaten befinden sich z.B. Hyaluronsäure, Chitin und Chitosan, Chondroitinsulfate, Stärke und Stärkederivate.

Unter den Cellulosederivaten befinden sich z.B. Methylcellulose, Carboxymethylcellulose, Hydroxyethylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose.

Unter den Schichtsilikaten befinden sich natürlich vorkommende und synthetische Tonerden wie z.B. Montmorillonit, Bentonit, Hektorit, Laponit, Magnesiumaluminiumsilikate wie Veegum®. Diese können als solche oder in modifizierter Form verwendet werden wie z.B. Stearylalkonium Hektorite.

Weiterhin können vorteilhaft auch Kieselsäuregele verwendet werden.

- Unter den Polyacrylaten befinden sich z.B. Carbopol Typen der Firma Goodrich (Carbopol 980, 981, 1382, 5984, 2984, ETD 2001, ETD 2020, ETD 2050, Ultrez 10 oder Pemulen TR1 & TR2).

Unter den Polymeren befinden sich z.B. Polyacrylamide (Seppigel 305), Polyvinylalkohole, PVP, PVP / VA Copolymere, Polyglycole.

- 10 Erfindungsgemäße als Emulsionen vorliegenden Zubereitungen enthalten einen oder mehrere Emulgatoren. Diese Emulgatoren können vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der nichtionischen, anionischen, kationischen oder amphoteren Emulgatoren.

Unter den nichtionischen Emulgatoren befinden sich

- 15 a) Partialfettsäureester und Fettsäureester mehrwertiger Alkohole und deren ethoxylierte Derivate (z. B. Glycerylmonostearate, Sorbitanstearate, Glycerylstearyl citrate, Sucrosetearate)
- b) ethoxylierte Fettalkohole und Fettsäuren
- c) ethoxilierte Fettamine, Fettsäureamide, Fettsäurealkanolamide
- 20 d) Alkylphenolpolyglycoether (z.B. Triton X)
- e) Zuckerderivate (Ester und/oder Ether von Glucose, Saccharose und anderen Zuckern; z.B. Alkylpolyglycoside wie Polyglyceryl-3-Methylglucose-Distearat, Methylglucosesesquisteart )

- 25 Unter den anionischen Emulgatoren befinden sich

- a) Seifen (z. B. Natriumstearat)
- b) Fettalkoholsulfate
- c) Mono-, Di- und Trialkylphosphosäureester und deren Ethoxylate

- 30 Unter den kationischen Emulgatoren befinden sich

- a) quaternäre Ammoniumverbindungen mit einem langkettigen aliphatischen Rest z.B. Distearylidimonium Chloride

Unter den amphoteren Emulgatoren befinden sich

- 35 a) Alkylamininoalkancarbonsäuren

- b) Betaine, Sulfobetaine
- c) Imidazolinderivate

Weiterhin gibt es natürlich vorkommende Emulgatoren, zu denen Bienenwachs, Wollwachs, Lecithin und Sterole gehören.

O/W-Emulgatoren können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der polyethoxylierten bzw. polypropoxylierten bzw. polyethoxylierten und polypropoxylierten Produkte, z.B.:

- 10 - der Fettalkoholethoxylate
- der ethoxylierten Wollwachsalkohole,
- der Polyethylenglycolether der allgemeinen Formel  $R-O-(CH_2-CH_2-O)_n-R'$ ,
- der Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel  $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-H$ ,
- 15 - der veretherten Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel  $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-R'$ ,
- der veresterten Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel  $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-C(O)-R'$ ,
- der Polyethylenglycolglycerinfettsäureester
- 20 - der ethoxylierten Sorbitanester
- der Cholesterinethoxylate
- der ethoxylierten Triglyceride
- der Alkylethercarbonsäuren der allgemeinen Formel  $R-O-(CH_2-CH_2-O)_n-CH_2-COOH$  und n eine Zahl von 5 bis 30 darstellen,
- 25 - der Polyoxyethylensorbitolfettsäureester,
- der Alkylethersulfate der allgemeinen Formel  $R-O-(CH_2-CH_2-O)_n-SO_3-H$
- der Fettalkoholpropoxylate der allgemeinen Formel  $R-O-(CH_2-CH(CH_3)-O)_n-H$ ,
- der Polypropylenglycolether der allgemeinen Formel  $R-O-(CH_2-CH(CH_3)-O)_n-R'$ ,
- 30 - der propoxylierten Wollwachsalkohole,
- der veretherten Fettsäurepropoxylate  $R-COO-(CH_2-CH(CH_3)-O)_n-R'$ ,
- der veresterten Fettsäurepropoxylate der allgemeinen Formel



- $R-COO-(-CH_2-CH(CH_3)-O-)_n-C(O)-R'$ ,
- der Fettsäurepropoxylate der allgemeinen Formel
  - $R-COO-(-CH_2-CH(CH_3)-O-)_n-H$ ,
  - der Polypropylenglycolglycerinfettsäureester
  - 5 - der propoxylierten Sorbitanester
  - der Cholesterinpropoxylate
  - der propoxylierten Triglyceride
  - der Alkylethercarbonsäuren der allgemeinen Formel
  - $R-O-(-CH_2-CH(CH_3)-O-)_n-CH_2-COOH$
  - 10 - der Alkylethersulfate bzw. die diesen Sulfaten zugrundeliegenden Säuren der allgemeinen Formel  $R-O-(-CH_2-CH(CH_3)-O-)_n-SO_3-H$
  - der Fettalkoholethoxylate/propoxylate der allgemeinen Formel
  - $R-O-X_n-Y_m-H$ ,
  - der Polypropylenglycolether der allgemeinen Formel
  - 15  $R-O-X_n-Y_m-R'$ ,
  - der veretherten Fettsäurepropoxylate der allgemeinen Formel
  - $R-COO-X_n-Y_m-R'$ ,
  - der Fettsäureethoxylate/propoxylate der allgemeinen Formel
  - $R-COO-X_n-Y_m-H$ ,

20

Erfindungsgemäß besonders vorteilhaft werden die eingesetzten polyethoxylierten bzw. polypropoxylierten bzw. polyethoxylierten und polypropoxylierten O/W-Emulgatoren gewählt aus der Gruppe der Substanzen mit HLB-Werten von 11 - 18, ganz besonders vorteilhaft mit mit HLB-Werten von 14,5 - 15,5, sofern die O/W-Emulgatoren gesättigte Reste

25 R und R' aufweisen. Weisen die O/W-Emulgatoren ungesättigte Reste R und/oder R' auf, oder liegen Isoalkylderivate vor, so kann der bevorzugte HLB-Wert solcher Emulgatoren auch niedriger oder darüber liegen.

Es ist von Vorteil, die Fettalkoholethoxylate aus der Gruppe der ethoxylierten Stearylalkohole, Cetylalkohole, Cetylstearylalkohole (Cetearylalkohole) zu wählen. Insbesondere

30 bevorzugt sind:

Polyethylenglycol(13)stearylether (Steareth-13), Polyethylenglycol(14)stearylether (Steareth-14), Polyethylenglycol(15)stearylether (Steareth-15), Polyethylenglycol(16)stearyl-

ether (Steareth-16), Polyethylenglycol(17)stearylether (Steareth-17), Polyethylenglycol(18)stearylether (Steareth-18), Polyethylenglycol(19)stearylether (Steareth-19), Polyethylenglycol(20)stearylether (Steareth-20),

- 5 Polyethylenglycol(12)isostearylether (Isosteareth-12), Polyethylenglycol(13)isostearylether (Isosteareth-13), Polyethylenglycol(14)isostearylether (Isosteareth-14), Polyethylenglycol(15)isostearylether (Isosteareth-15), Polyethylenglycol(16)isostearylether (Isosteareth-16), Polyethylenglycol(17)isostearylether (Isosteareth-17), Polyethylenglycol(18)isostearylether (Isosteareth-18), Polyethylenglycol(19)isostearylether (Isosteareth-19), Polyethylenglycol(20)isostearylether (Isosteareth-20),

- 15 Polyethylenglycol(13)cetylether (Ceteth-13), Polyethylenglycol(14)cetylether (Ceteth-14), Polyethylenglycol(15)cetylether (Ceteth-15), Polyethylenglycol(16)cetylether (Ceteth-16), Polyethylenglycol(17)cetylether (Ceteth-17), Polyethylenglycol(18)cetylether (Ceteth-18), Polyethylenglycol(19)cetylether (Ceteth-19), Polyethylenglycol(20)cetylether (Ceteth-20),

- 20 Polyethylenglycol(13)isocetylether (Isoceteth-13), Polyethylenglycol(14)isocetylether (Isoceteth-14), Polyethylenglycol(15)isocetylether (Isoceteth-15), Polyethylenglycol(16)isocetylether (Isoceteth-16), Polyethylenglycol(17)isocetylether (Isoceteth-17), Polyethylenglycol(18)isocetylether (Isoceteth-18), Polyethylenglycol(19)isocetylether (Isoceteth-19), Polyethylenglycol(20)isocetylether (Isoceteth-20),

- 25 Polyethylenglycol(12)oleylether (Oleth-12), Polyethylenglycol(13)oleylether (Oleth-13), Polyethylenglycol(14)oleylether (Oleth-14), Polyethylenglycol(15)oleylether (Oleth-15),

Polyethylenglycol(12)laurylether (Laureth-12), Polyethylenglycol(12)isolaurylether (Isolaureth-12).

- 30 Polyethylenglycol(13)cetylstearylether (Ceteareth-13), Polyethylenglycol(14)cetylstearylether (Ceteareth-14), Polyethylenglycol(15)cetylstearylether (Ceteareth-15), Polyethylenglycol(16)cetylstearylether (Ceteareth-16), Polyethylenglycol(17)cetylstearylether (Ceteareth-17), Polyethylenglycol(18)cetylstearylether (Ceteareth-18), Polyethylenglycol(19)cetylstearylether (Ceteareth-19), Polyethylenglycol(20)cetylstearylether (Ceteareth-20),

Es ist ferner von Vorteil, die Fettsäureethoxylate aus folgender Gruppe zu wählen:

Polyethylenglycol(20)stearat, Polyethylenglycol(21)stearat, Polyethylenglycol(22)stearat, Polyethylenglycol(23)stearat, Polyethylenglycol(24)stearat, Polyethylenglycol(25)stearat,

5

Polyethylenglycol(12)isostearat, Polyethylenglycol(13)isostearat, Polyethylenglycol(14)-isostearat, Polyethylenglycol(15)isostearat, Polyethylenglycol(16)isostearat, Polyethylenglycol(17)isostearat, Polyethylenglycol(18)isostearat, Polyethylenglycol(19)isostearat, Polyethylenglycol(20)isostearat, Polyethylenglycol(21)isostearat, Polyethylenglycol(22)isostearat, Polyethylenglycol(23)isostearat, Polyethylenglycol(24)isostearat, Polyethylenglycol(25)isostearat,

10

Polyethylenglycol(12)oleat, Polyethylenglycol(13)oleat, Polyethylenglycol(14)oleat, Polyethylenglycol(15)oleat, Polyethylenglycol(16)oleat, Polyethylenglycol(17)oleat, Polyethylenglycol(18)oleat, Polyethylenglycol(19)oleat, Polyethylenglycol(20)oleat

15

Als ethoxylierte Alkylethercarbonsäure bzw. deren Salz kann vorteilhaft das Natriumlaureth-11-carboxylat verwendet werden.

20 Als Alkylethersulfat kann Natrium Laureth 1-4 sulfat vorteilhaft verwendet werden.

Als ethoxyliertes Cholesterinderivat kann vorteilhaft Polyethylenglycol(30)Cholesteryl-ether verwendet werden. Auch Polyethylenglycol(25)Sojasterol hat sich bewährt.

25 Als ethoxylierte Triglyceride können vorteilhaft die Polyethylenglycol(60) Evening Primrose Glycerides verwendet werden (Evening Primrose = Nachtkerze)

Weiterhin ist von Vorteil, die Polyethylenglycolglycerinfettsäureester aus der Gruppe Polyethylenglycol(20)glyceryllaurat, Polyethylenglycol(21)glyceryllaurat, Polyethylenglycol(22)glyceryllaurat, Polyethylenglycol(23)glyceryllaurat, Polyethylenglycol(6)glycerylcaprat/caprinat, Polyethylenglycol(20)glyceryl-oleat, Polyethylenglycol(20)glycerylisostearat, Polyethylenglycol(18)glyceryl-oleat/cocoat zu wählen.

30

Es ist ebenfalls günstig, die Sorbitanester aus der Gruppe Polyethylenglycol(20)sorbitanmonolaurat, Polyethylenglycol(20)sorbitanmonostearat, Polyethylenglycol(20)sorbitanmonoistearat, Polyethylenglycol(20)sorbitanmonopalmitat, Polyethylenglycol(20)sorbitanmonooleat zu wählen.

5

Als vorteilhafte W/O-Emulgatoren können eingesetzt werden: Fettalkohole mit 8 bis 30 Kohlenstoffatomen, Monoglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen, Diglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen, Monoglycerinether gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkohole einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen, Diglycerinether gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkohole einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen, Propylenglycolester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen sowie Sorbitanester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen.

20

Insbesondere vorteilhafte W/O-Emulgatoren sind Glycerylmonostearat, Glycerylmonoistearat, Glycerylmonomyristat, Glycerylmonooleat, Diglycerylmonostearat, Diglycerylmonoistearat, Propylenglycolmonostearat, Propylenglycolmonoistearat, Propylenglycolmonocaprylat, Propylenglycolmonolaurat, Sorbitanmonoistearat, Sorbitanmonolaurat, Sorbitanmonocaprylat, Sorbitanmonooleat, Saccharosedistearat, Cetylalkohol, Stearylalkohol, Arachidylalkohol, Behenylalkohol, Isobehenylalkohol, Selachylalkohol, Chimylalkohol, Polyethylenglycol(2)stearylether (Steareth-2), Glycerylmonolaurat, Glycerylmonocaprinat, Glycerylmonocaprylat.

30

Erfindungsgemäß besonders bevorzugte Ausführungsformen der erfindungsgemäßen Zubereitungen sind dadurch gekennzeichnet, dass sie ein oder mehrere Cyclodextrine und/oder Cyclodextrinderivate enthalten. Unter Cyclodextrinen und/oder Cyclodextrinderivaten sind erfindungsgemäß zu verstehen die nativen Cyclodextrine  $\alpha$ -,  $\beta$ - und  $\gamma$ -Cyclodextrin sowie die Derivate dieser Spezies, insbesondere alle ganz oder

teilweise an den Hydroxylgruppen veretherten und/oder veresterten und/oder anders derivatisierten  $\alpha$ -,  $\beta$ - und  $\gamma$ -Cyclodextrine wie das  $\alpha$ -Cyclodextrin,  $\beta$ -Cyclodextrin, Hydroxypropyl- $\beta$ -cyclodextrin, Hydroxypropyl- $\gamma$ -cyclodextrin, teilweise methyliertes (random-Methyl-)  $\beta$ -Cyclodextrin und/oder  $\gamma$ -Cyclodextrin.

5

Die Verbesserung der Löslichkeit schwerlöslicher Substanzen in Gegenwart von Cyclodextrinen in wässrigem Milieu ist für einzelne Substanzen beschrieben. Vorteilhaft können sowohl die Einschlußverbindungen einer Substanz, auch Gast genannt, mit einer Cyclodextrinspezies, wobei sowohl 1:1 oder 1:2 Komplexe, wie auch Komplexe mit  
10 weiteren molaren Verhältnissen (Gast: Cyclodextrin) möglich sind, sowie auch deren physikalische Mischung sein.

Cyclodextrine und ihre Derivate können aufgrund Ihrer Struktur Inklusionskomplexe bilden. Sie sind zur "molekularen Verkapselung" von Wirkstoffen geeignet (z.B. als  
15 schützende Umhüllung empfindlicher Moleküle in kosmetischen und pharmazeutischen Formulierungen).

Die erfindungsgemäß verwendeten Cyclodextrine bzw. Cyclodextrin-Gast-Inklusionskomplexe bzw. die Cyclodextrin-Substanz Mischungen lassen sich ohne  
20 Schwierigkeiten in gängige kosmetische oder dermatologische Formulierungen einarbeiten.

Erfindungsgemäß werden das oder die Cyclodextrine und/oder deren Derivate vorteilhaft in einer Konzentration von 0,0005 bis 20,0 Gewichts-%, bevorzugt in einer Konzentration  
25 von 0,01 bis 10 Gew.- % und besonders bevorzugt in einer Konzentration von 0,1 bis 5,0 Gewichts-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung eingesetzt.

Die erfindungsgemäß besonders bevorzugten Cyclodextrinspezies sind  
30  $\gamma$ -Cyclodextrin sowie Hydroxypropyl- $\beta$ -Cyclodextrin.

Auch andere Formen der Verkapselung der erfindungsgemäßen 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und -glycoside sind vorteilhaft im Sinne der Erfindung anwendbar. Besonders vorteilhaft sind beispielsweise die Verkapselungsmethoden der Lipidpartikelverkapselung, wie sie in der DE 19945203 A1, der WO 94/20072 oder der  
35 WO 00/67728 beschrieben werden.

Die Erfindung ist keineswegs auf die hier erwähnten kosmetischen beziehungsweise dermatologischen Wirk-, Hilfs- und Zusatzstoffe beschränkt.

- 5 Erfindungsgemäß ist Verwendung von einem oder mehreren 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten und/oder deren Glycosiden zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Hautalterungserscheinungen.

- 10 Erfindungsgemäß ist ferner die Verwendung von einem oder mehreren 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten und/oder deren Glycosiden zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung und/oder Prophylaxe von entzündlichen Hautzuständen.

- 15 Nicht zuletzt ist die Verwendung von ein oder mehreren 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten und/oder deren Glycosiden zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung und/oder Prophylaxe von unreiner Haut und Akne erfindungsgemäß.

- 20 Erfindungsgemäß ist auch die Verwendung von einem oder mehreren 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten und/oder deren Glycosiden zur Herstellung eines Kosmetikums zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Hautalterungserscheinungen.

- 25 Erfindungsgemäß ist ferner die Verwendung von einem oder mehreren 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten und/oder deren Glycosiden zur Herstellung eines Kosmetikums zur Behandlung und/oder Prophylaxe von entzündlichen Hautzuständen.

- 30 Nicht zuletzt ist die Verwendung von ein oder mehreren 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten und/oder deren Glycosiden zur Herstellung eines Kosmetikums zur Behandlung und/oder Prophylaxe von unreiner Haut und Akne erfindungsgemäß.

Die Prophylaxe bzw. die kosmetische oder dermatologische Behandlung mit den erfindungsgemäß verwendeten 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten und/oder deren Glycosiden bzw. mit den kosmetischen oder topischen dermatologischen Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendeten 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten

und/oder deren Glycosiden erfolgt in der üblichen Weise, und zwar dergestalt, dass die erfindungsgemäß verwendeten 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten und/oder deren Glycosiden bzw. die kosmetischen oder topischen dermatologischen Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendeten 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten und/oder deren Glycosiden auf die betroffenen Hautstellen aufgetragen wird.

Ein weiteres Teilgebiet der Kosmetik ist neben der Hautgesundheit und der Hautpflege auch die Haarpflege. Überraschend eignen sich die erfindungsgemäßen Zubereitungen zur Behandlung und Pflege der Hautanhangsgebilde, das heißt der Nägel, der Schweißdrüsen, der Talgdrüsen, der Haarfollikel und insbesondere der Haare. Insbesondere die Behandlung und Pflege von fettigen Haaren und/oder Schuppen ist erfindungsgemäß vorteilhaft, da diese Erscheinungsformen eine gewisse Verwandtschaft mit den Erscheinungsformen der unreinen Haut (erhöhte Talgproduktion) bzw. der trockenen, entzündlichen Haut aufweisen. Dabei können die erfindungsgemäßen Zubereitungen in Form von Shampoos, Konditionieren, Spülungen und Kuren erfindungsgemäß vorteilhaft eingesetzt werden. Damit ist auch die Verwendung von ein oder mehreren 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten und/oder deren Glycosiden zur Herstellung eines Arzneimittels und/oder eines Kosmetikums zur Behandlung und Pflege der Hautanhangsgebilde erfindungsgemäß.

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen, ohne sie einzuschränken. Alle Mengenangaben, Anteile und Prozentanteile sind, soweit nicht anders angegeben, auf das Gewicht und die Gesamtmenge bzw. auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen bezogen.

**1. Beispiele O/W-Creme**

Beispiele	1	2	3	4	5
Glycerylstearatcitrat			2,00		2,00
Glycerylsterat selbstemulgierend	4,00	2,00			
PEG-40-Stearat	1,00				
Polyglyceryl-3-Methylglucose-Distearat				3,00	
Sorbitanstearat					2,00
Stearinsäure		1,00			
Polyoxyethylen(20)-cetylstearylether					
Stearylalkohol			5,00		
Cetylalkohol	3,00	2,00		3,00	
Cetylstearylalkohol					2,00
C12-15 Alkylbenzoat					
Caprylic-/Capric-Triglycerid	5,00	3,00	4,00	3,00	3,00
Octyldodecanol			2,00		2,00
Dicaprylether		4,00		2,00	1,00
Paraffinum liquidum	5,00	2,00		3,00	
Titandioxid			1,00		
4-Methylbenzyliden Campher			1,00		
1-(4-tert-Butylphenyl)-3-(4-methoxyphenyl)- 1,3-propandion			0,50		
2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside	0,20	0,50	0,10	1,00	0,30
Tocopherol	0,1				0,20
Biotin			0,05		
Ethylendiamintetraessigsäure Trinatrium	0,1		0,10	0,1	
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Xanthan Gummi					
Polyacrylsäure	3,00	0,1		0,1	0,1
Natronlauge 45%	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Glycerin	5,00	3,00	4,00	3,00	3,00
Butylenglycol		3,00			
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.



Wasser	ad 100	Ad 100	Ad 100	Ad 100	Ad 100
--------	--------	--------	--------	--------	--------

**2. Beispiele O/W-Creme**

Beispiele	6	7	8	9	10
Glycerylstearatcitrat		2,00	2,00		
Glycerylsterat selbstemulgierend	5,00				
Stearinsäure				2,50	3,50
Stearylalkohol	2,00				
Cetylalkohol				3,00	4,50
Cetylstearylalkohol		3,00	1,00		0,50
C12-15 Alkylbenzoat		2,00	3,00		
Caprylic-/Capric-Triglycerid	2,00				
Octyldodecanol	2,00	2,00		4,00	6,00
Dicaprylylether					
Paraffinum liquidum		4,00	2,00		
Cyclisches Dimethylpolysiloxan				0,50	2,00
Dimethicon Polydimethylsiloxan	2,00				
Titandioxid	2,00				
4-Methylbenzyliden Campher	1,00				1,00
1-(4-tert-Butylphenyl)-3-(4-methoxyphenyl)- 1,3-propandion	0,50				0,50
2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside	0,20	0,70	0,25	1,00	0,40
Tocopherol					0,05
Ethylendiamintetraessigsäure Trinatrium			0,20		0,20
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Xanthan Gummi			0,20		
Polyacrylsäure	0,15	0,1		0,05	0,05
Natronlauge 45%	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Glycerin	3,00		3,00	5,00	3,00
Butylenglycol		3,00			
Ethanol		3,00		3,00	
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	Ad 100	Ad 100	Ad 100	Ad 100	Ad 100

**3. Beispiele W/O-Emulsionen**

	1	2	3	4	5
Cetyldimethiconcopolyol		2,50		4,00	
Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat	5,00				4,50
PEG-30-dipolyhydroxystearat			5,00		
2-Ethylhexyl Methoxyzinnamat		8,00		5,00	4,00
2,4-Bis-(4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxyl)-phenyl)-6-(4-methoxyphenyl)-(1,3,5)-triazin	2,00	2,50		2,00	2,50
1-(4-tert-Butylphenyl)-3-(4-methoxyphenyl)-1,3-propandion			2,00	1,00	
Diethylhexyl Butamidotriazon	3,00	1,00			3,00
Ethylhexyl Triazon			3,00	4,00	
4-Methylbenzyliden Campher		2,00		4,00	2,00
Octocrylen	7,00	2,50	4,00		2,50
Diethylhexyl Butamidotriazon	1,00			2,00	
Phenylen-1,4-bis-(mononatrium, 2-benzimidazol-5,7-disulfonsäure)	1,00	2,00	0,50		
Phenylbenzimidazol Sulfonsäure	0,50			3,00	2,00
Titandioxid		2,00	1,50		3,00
Zinkoxid	3,00	1,00	2,00	0,50	
Paraffinum liquidum			10,0		8,00
C12-15 Alkyl-Benzoat				9,00	
Dicaprylether	10,00				7,00
Butylen-Glycol-Dicaprylat/-Dicaprat			2,00	8,00	4,00
Dicaprylylcarbonat	5,00		6,00		
Dimethicon Polydimethylsiloxan		4,00	1,00	5,00	
Phenylmethylpolysiloxan	2,00	25,00			2,00
Shea Butter			3,00		
PVP Hexadecencopolymer	0,50			0,50	1,00
Octoxyglycerin		0,30	1,00		0,50
Glycerin	3,00	7,50		7,50	2,50
Glycinsoja		1,00	1,50		
Magnesiumsulfat	1,00	0,50		0,50	

Magnesiumchlorid			1,00		0,70
Tocopherolacetat	0,50		0,25		1,00
2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside	0,10	0,60	1,00	1,00	0,80
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Ethanol	3,00		1,50		1,00
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	ad.	ad.	ad.	ad.	ad.
	100	100	100	100	100

**4. Beispiele W/O Emulsionen**

	6	7
Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat	4,00	5,00
PEG-30-dipolyhydroxystearat		
Lanolinalkohol	0,50	1,50
Isohexadecan	1,00	2,00
Myristyl-Myristat	0,50	1,50
Vaseline	1,00	2,00
1-(4-tert-Butylphenyl)-3-(4-methoxyphenyl)- 1,3-propandion	0,50	1,50
4-Methylbenzyliden Campher		3,00
Butylen-Glycol-Dicaprylat/-Dicaprat	4,00	5,00
Shea Butter		0,50
Butylenglycol		6,00
Octoxyglycerin		3,00
Glycerin	5,00	
Tocopherolacetat	0,50	1,00
2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside	0,20	0,45
Ethylendiamintetraessigsaeure	0,20	0,20
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.
Ethanol		3,00
Parfum	q.s.	q.s.
Wasser	ad. 100	ad. 100

**5. Beispiele Hydrodispersionen**

	1	2	3	4	5
Polyoxyethylen(20)cetylstearylether	1,00			0,5	
Cetylalkohol			1,00		
Natriumpolyacrylat		0,20		0,30	
Acrylate /C10-30-Alkyl-Acrylat	0,50		0,40	0,10	0,10
Crosspolymer					
Xanthan Gummi		0,30	0,15		0,50
2-Ethylhexyl Methoxyzinnamat				5,00	8,00
2,4-Bis-(4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxyl)-phenyl)-6-(4-methoxyphenyl)-(1,3,5)-triazin		1,50		2,00	2,50
1-(4-tert-Butylphenyl)-3-(4-methoxyphenyl)-1,3-propandion	1,00		2,00		
Diethylhexyl Butamidotriazon		2,00		2,00	1,00
Ethylhexyl Triazon	4,00		3,00	4,00	
4-Methylbenzyliden Campher					2,00
Octocrylen		4,00	4,00		2,50
Phenylen-1,4-bis-(mononatrium, 2-benzimidazol-5,7-disulfonsäure	1,00		0,50		2,00
Phenylbenzimidazol Sulfonsäure	0,50			3,00	
Titandioxid	0,50		2,00	3,00	1,00
Zinkoxid	0,50	1,00	3,00		2,00
C12-15 Alkyl Benzoat	2,00	2,50			
Dicaprylether		4,00			
Butylenglycol-Dicaprylat/-Dicaprat	4,00		2,00	6,00	
Dicaprylcarbonat		2,00	6,00		
Dimethicon Polydimethylsiloxan		0,50	1,00		
Phenylmethylpolysiloxan	2,00			0,50	2,00
Shea Butter		2,00			
PVP Hexadecencopolymer	0,50			0,50	1,00
Octoxyglycerin			1,00		0,50
Glycerin	3,00	7,50		7,50	2,50

Glycinsoja			1,50		
Tocopherolacetat	0,50		0,25		1,00
2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside	0,15	0,60	1,00	1,00	0,80
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Ethanol	3,00	2,00	1,50		1,00
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	ad. 100	ad. 100	ad. 100	ad. 100	ad. 100

#### 6.Beispiel (Gelcreme)

Acrylat /C10-30 Alkylacrylat Crosspolymer	0,40
Polyacrylsaeure	0,20
Xanthan Gummi	0,10
Cetearylalkohol	3,00
C12-15 Alkylbenzoat	4,00
Caprylic/Capric Triglycerid	3,00
Cyclisches Dimethylpolysiloxan	5,00
Dimeticon Polydimethylsiloxan	1,00
2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside	0,05
Glycerin	3,00
Natriumhydroxid	q.s.
Konservierungsmittel	q.s.
Parfum	q.s.
Wasser	ad 100,0
pH-Wert eingestellt auf 6.0	

**7. Beispiel (W/O-Creme)**

Polyglyceryl-3-Diisostearate	3,50
Glycerin	3,00
Polyglyceryl-2-Dipolyhydroxystearate	3,50
2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside	0,60
Konservierungsmittel	q.s.
Parfum	q.s.
Wasser	ad 100,0
Magnesiumsulfat	0,6
Isopropylstearat	2,0
Caprylylether	8,0
Cetearylisononanoat	6,0

**5 8. Beispiel (W/O/W-Creme):**

Glycerylstearat	3,00
PEG-100-Stearat	0,75
Behenylalkohol	2,00
Caprylic-/Capric-Triglycerid	8,0
Octyldodecanol	5,00
C12-15 Alkylbenzoat	3,00
2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside	0,50
Magnesiumsulfat (MgSO <sub>4</sub> )	0,80
Ethylendiamintetraessigsaeure	0,10
Konservierungsmittel	q.s.
Parfum	q.s.
Wasser	ad 100,0
pH-Wert eingestellt auf 6.0	



**9. Beispiel (Duschbad)**

Natriumlaurethsulfat	33,00
Kalium-Cocoyl-hydrolysiertes Kollagen (30%)	11,00
Cocoamphodiacetat (30%)	5,00
PEG-7-Glyceryl Cocoat	2,00
Cocamid MEA	1,00
Natriumchlorid	0,50
2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside	0,05
Zitronensäure	0,02
Konservierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm	q.s.
Wasser	ad 100

**10. Beispiel (Haarkur)**

Hydroxypropylmethylcellulose	0,50
Cetrimoniumbromid	1,00
Glycerin	3,00
Cetearylalkohol	2,50
Benzophenon-4	0,4
Glycerylstearat	2,00
2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside	0,1
Konservierungsmittel, Parfüm, pH- Einstellung	q.s.
Wasser	ad 100
Der pH-Wert wird auf 3,5 eingestellt.	

**11. Beispiel (Haarspülung)**

Behentrimoniumchlorid	1,00
Glycerin	3,00
Benzophenon-4	0,25
Hydroxyethylcellulose	0,20
Cetearylalkohol	3,00
2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside	0,2
Folsäure	0,80
Konservierungsmittel, Parfüm, pH-Einstellung	q.s.
Wasser	ad 100
Der pH-Wert wird auf 3,0 eingestellt.	

**12. Beispiel (Conditioner-Shampoo mit Perlglanz)**

	1	2	3
Polyquaternium-10	0,5	0,5	0,5
Natriumlaurethsulfat	9,0	9,0	9,0
Benzophenon-3		0,5	
Benzophenon-4			0,4
Cocoamidopropylbetain	2,5	2,5	2,5
Perlglanzmittel	2,0	2,0	2,0
2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside	0,06	0,15	0,01
Dinatrium EDTA	0,1	0,2	0,15
Konservierungsmittel, Parfüm, Verdicker, pH-Einstellung und Lösungsvermittler	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser, VES (vollentsalzt)	ad 100,0	ad 100,0	ad 100,0
Der pH-Wert wird auf 6 eingestellt.			

**13. Beispiel (klares Conditioner-Shampoo)**

	1	2	3
Polyquaternium-10	0,5	0,5	0,5
Benzophenon-4		0,4	
2-Ethylhexyl Methoxyzinnamat			0,2
Natriumlaurethsulfat	9,0	9,0	9,0
Cocoamidopropylbetain	2,5	2,5	2,5
2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside	0,02	0,05	0,05
Iminodibernsteinsäure, Na-Salz	0,2	0,3	0,8
Konvierungsmittel, Parfüm, Verdicker, pH-Einstellung und Lösungsvermittler	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser, VES (vollentsalzt)	ad 100,0	ad 100,0	ad 100,0
Der pH-Wert wird auf 6 eingestellt.			

**14. Beispiel (klares Light-Shampoo mit Volumeneffekt)**

	1	2	3
Natriumlaurethsulfat	10,0	10,0	10,0
Cocoamidopropylbetain	2,5	2,5	2,5
2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside	0,5	0,6	0,3
Dinatrium EDTA	0,2	0,15	0,7
Konvierungsmittel, Parfüm, Verdicker pH-Einstellung und Lösungsvermittler	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser, VES (vollentsalzt)	ad 100,0	ad 100,0	ad 100,0
Der pH-Wert wird auf 5,5 eingestellt.			

Patentansprüche

1. Kosmetische und/oder dermatologische Zubereitung enthaltend ein oder mehrere 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside neben gegebenenfalls  
5 weiteren kosmetischen und/oder dermatologischen Wirk-, Hilfs- und Zusatzstoffen.
2. Kosmetische und/oder dermatologische Zubereitung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass die Zubereitung in Form einer Emulsion vorliegt.
3. Kosmetische und/oder dermatologische Zubereitung nach einem der Ansprüche 1  
10 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass ein oder mehrere 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside in einer Konzentration von 0,001 bis 10 Gewichts-%, bevorzugt von 0,05 bis 5 Gewichts-% und ganz besonders bevorzugt von 0,01 bis 2 Gewichts-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung eingesetzt werden.
4. Kosmetische und/oder dermatologische Zubereitung nach einem der Ansprüche 1 bis  
15 3, dadurch gekennzeichnet, dass ein oder mehrere 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside in Form von Pflanzenextrakten der Zubereitung zugesetzt sind.
5. Kosmetische und/oder dermatologische Zubereitung nach Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, dass es sich bei den Pflanzenextrakten um Extrakte von *Arctium*  
20 *lappa* L. (Große Klette) oder *Steganotaenia araliacea* (Carrot Tree) handelt.
6. Kosmetische und/oder dermatologische Zubereitung nach einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass als 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivate und/oder deren Glycoside Arctiin, Arctigenin, Prestegan B, Matairesinol, Trachelosid und/oder Trachelogenin eingesetzt werden.
- 25 7. Verwendung von einem oder mehreren 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten und/oder deren Glycosiden nach einem der vorhergehenden Ansprüche zur Herstellung eines Arzneimittels und/oder eines Kosmetikums zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Hautalterungserscheinungen.
8. Verwendung von einem oder mehreren 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten und/oder  
30 deren Glycosiden nach einem der vorhergehenden Ansprüche zur Herstellung eines Arzneimittels und/oder eines Kosmetikums zur Behandlung und/oder Prophylaxe von entzündlichen Hautzuständen.
9. Verwendung von ein oder mehreren 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten und/oder deren Glycosiden nach einem der vorhergehenden Ansprüche zur Herstellung eines

Arzneimittels und/oder eines Kosmetikums zur Behandlung und/oder Prophylaxe von unreiner Haut und Akne.

10. Verwendung von ein oder mehreren 2,3-Dibenzylbutyrolactonderivaten und/oder deren Glycosiden nach einem der vorhergehenden Ansprüche zur Herstellung eines
- 5     Arzneimittels und/oder eines Kosmetikums zur Behandlung und Pflege der Haare und Hautanhangsgebilde.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 03/05347

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**

IPC 7 A61K7/06 A61K7/48

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

CHEM ABS Data, EPO-Internal, PAJ, WPI Data, BIOSIS

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	RO 116 865 B (IONITA MANZATU VASILE ;PANTUROIU MARIANA (RO); CARASAVA MARIAN (RO) 30 July 2001 (2001-07-30) page 4, line 95 - line 114; claims; example 4	1-5,7-10
X	RO 117 295 B (MOTOANGA VERONICA ;MANZATU IOAN (RO); MANZATU LILIANA (RO); SPETEA) 30 January 2002 (2002-01-30) page 5, line 153 - line 175; claims; examples	1-5,7-10
P,X	WO 02 092030 A (GARCIA LOZANO MARINA) 21 November 2002 (2002-11-21) page 7, line 8 - line 35 page 3, line 17; claims 1,7-9	1,4,5,10
	-/--	

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents:

\*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

\*E\* earlier document but published on or after the international filing date

\*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

\*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

\*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

\*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

\*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

\*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

\*8\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

9 September 2003

Date of mailing of the international search report

26/09/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Boeker, R

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 03/05347

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 5 962 517 A (H. MURAD ) 5 October 1999 (1999-10-05) column 7, line 24 - line 27; claims 1,15; example 3	1,4,5, 8-10
X	--- PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 018, no. 075 (C-1163), 8 February 1994 (1994-02-08) & JP 05 286835 A (KANEBO LTD), 2 November 1993 (1993-11-02) abstract	1,4,6,10
X	--- DATABASE WPI Section Ch, Week 199954 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class D21, AN 1994-061970 XP002253894 & JP 02 977648 B (KANEBO LTD), 15 November 1999 (1999-11-15) abstract	1,4,6,10
X	--- PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1999, no. 14, 22 December 1999 (1999-12-22) & JP 11 255639 A (KANSAI KOUSO KK), 21 September 1999 (1999-09-21) abstract	1,6
X	--- PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2002, no. 03, 3 April 2002 (2002-04-03) & JP 2001 322940 A (KAO CORP), 20 November 2001 (2001-11-20) abstract	1,4,5,7, 8
X	--- PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2002, no. 02, 2 April 2002 (2002-04-02) & JP 2001 278769 A (KAO CORP), 10 October 2001 (2001-10-10) abstract	1,4,5,7
X	--- PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2000, no. 22, 9 March 2001 (2001-03-09) & JP 2001 139429 A (KANEBO LTD), 22 May 2001 (2001-05-22) abstract	1,4,5,10
X	--- PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1999, no. 14, 22 December 1999 (1999-12-22) & JP 11 263718 A (KAO CORP), 28 September 1999 (1999-09-28) abstract	1,3-5,7
	-/-	

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (July 1992)

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 03/05347

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1998, no. 08, 30 June 1998 (1998-06-30) & JP 10 072336 A (KAO CORP), 17 March 1998 (1998-03-17) abstract	1,4,5,7
X	----- DATABASE WPI Section Ch, Week 199514 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class B04, AN 1995-101775 XP002253895 & JP 07 025740 A (SANSEI SEIYAKU KK), 27 January 1995 (1995-01-27) abstract	1-5
X	----- PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 010, no. 078 (C-335), 27 March 1986 (1986-03-27) & JP 60 214721 A (INAHATA KOURIYOU KK;OTHERS: 02), 28 October 1985 (1985-10-28) abstract	1,4,5,7
X	----- DATABASE WPI Section Ch, Week 199821 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class B04, AN 1998-234687 XP002253896 & JP 10 072336 A (KAO CORP), 17 March 1998 (1998-03-17) abstract	1,4,5,7
A	----- DATABASE BIOSIS 'Online! BIOSCIENCES INFORMATION SERVICE, PHILADELPHIA, PA, US; February 2001 (2001-02) CHO JAE YOUNG ET AL: "Savinin, a lignan from Pterocarpus santalinus inhibits tumor necrosis factor-alpha production and T cell proliferation." Database accession no. PREV200100195141 XP002253893 abstract & BIOLOGICAL & PHARMACEUTICAL BULLETIN, vol. 24, no. 2, February 2001 (2001-02), pages 167-171, ISSN: 0918-6158	1,6,8
A	----- KR 271 743 B (HAN BYUNG HOON) 18 August 2000 (2000-08-18) abstract	1,6,8

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (July 1992)



# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 03/05347

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
RO 116865	B	30-07-2001	NONE	
RO 117295	B	30-01-2002	NONE	
WO 02092030	A	21-11-2002	ES 2176124 A1 WO 02092030 A1	16-11-2002 21-11-2002
US 5962517	A	05-10-1999	NONE	
JP 05286835	A	02-11-1993	JP 3014214 B2	28-02-2000
JP 2977648	B	25-01-1994	JP 2977648 B2 JP 6016525 A	15-11-1999 25-01-1994
JP 11255639	A	21-09-1999	NONE	
JP 2001322940	A	20-11-2001	NONE	
JP 2001278769	A	10-10-2001	NONE	
JP 2001139429	A	22-05-2001	NONE	
JP 11263718 9	A		NONE	
JP 10072336 9	A		NONE	
JP 7025740	A	27-01-1995	NONE	
JP 60214721 9	A		NONE	
JP 10072336	A	17-03-1998	JP 2003176208 A	24-06-2003
KR 271743	B	15-11-2000	KR 271743 B1	15-11-2000

## INTERNATIONALER RESEARCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 03/05347

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
IPK 7 A61K7/06 A61K7/48

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RESEARCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
IPK 7 A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

CHEM ABS Data, EPO-Internal, PAJ, WPI Data, BIOSIS

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	RO 116 865 B (IONITA MANZATU VASILE ;PANTUROIU MARIANA (RO); CARASAVA MARIAN (RO) 30. Juli 2001 (2001-07-30) Seite 4, Zeile 95 - Zeile 114; Ansprüche; Beispiel 4	1-5,7-10
X	RO 117 295 B (MOTOANGA VERONICA ;MANZATU IOAN (RO); MANZATU LILIANA (RO); SPETEA) 30. Januar 2002 (2002-01-30) Seite 5, Zeile 153 - Zeile 175; Ansprüche; Beispiele	1-5,7-10
P,X	WO 02 092030 A (GARCIA LOZANO MARINA) 21. November 2002 (2002-11-21) Seite 7, Zeile 8 - Zeile 35 Seite 3, Zeile 17; Ansprüche 1,7-9 -/-	1,4,5,10



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

\*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

\*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

\*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

\*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

\*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

\*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

\*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

\*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

\*Z\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

9. September 2003

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

26/09/2003

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Boeker, R

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	US 5 962 517 A (H. MURAD ) 5. Oktober 1999 (1999-10-05) Spalte 7, Zeile 24 - Zeile 27; Ansprüche 1,15; Beispiel 3 ---	1,4,5, 8-10
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 018, no. 075 (C-1163), 8. Februar 1994 (1994-02-08) & JP 05 286835 A (KANEBO LTD), 2. November 1993 (1993-11-02) Zusammenfassung ---	1,4,6,10
X	DATABASE WPI Section Ch, Week 199954 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class D21, AN 1994-061970 XP002253894 & JP 02 977648 B (KANEBO LTD), 15. November 1999 (1999-11-15) Zusammenfassung ---	1,4,6,10
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1999, no. 14, 22. Dezember 1999 (1999-12-22) & JP 11 255639 A (KANSAI KOUSO KK), 21. September 1999 (1999-09-21) Zusammenfassung ---	1,6
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2002, no. 03, 3. April 2002 (2002-04-03) & JP 2001 322940 A (KAO CORP), 20. November 2001 (2001-11-20) Zusammenfassung ---	1,4,5,7, 8
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2002, no. 02, 2. April 2002 (2002-04-02) & JP 2001 278769 A (KAO CORP), 10. Oktober 2001 (2001-10-10) Zusammenfassung ---	1,4,5,7
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2000, no. 22, 9. März 2001 (2001-03-09) & JP 2001 139429 A (KANEBO LTD), 22. Mai 2001 (2001-05-22) Zusammenfassung ---	1,4,5,10
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1999, no. 14, 22. Dezember 1999 (1999-12-22) & JP 11 263718 A (KAO CORP), 28. September 1999 (1999-09-28) Zusammenfassung ---	1,3-5,7
	---	

-/--

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1998, no. 08, 30. Juni 1998 (1998-06-30) & JP 10 072336 A (KAO CORP), 17. März 1998 (1998-03-17) Zusammenfassung ---	1,4,5,7
X	DATABASE WPI Section Ch, Week 199514 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class B04, AN 1995-101775 XP002253895 & JP 07 025740 A (SANSEI SEIYAKU KK), 27. Januar 1995 (1995-01-27) Zusammenfassung ---	1-5
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 010, no. 078 (C-335), 27. März 1986 (1986-03-27) & JP 60 214721 A (INAHATA KOURIYOU KK;OTHERS: 02), 28. Oktober 1985 (1985-10-28) Zusammenfassung ---	1,4,5,7
X	DATABASE WPI Section Ch, Week 199821 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class B04, AN 1998-234687 XP002253896 & JP 10 072336 A (KAO CORP), 17. März 1998 (1998-03-17) Zusammenfassung ---	1,4,5,7
A	DATABASE BIOSIS 'Online! BIOSCIENCES INFORMATION SERVICE, PHILADELPHIA, PA, US; Februar 2001 (2001-02) CHO JAE YOUL ET AL: "Savinin, a lignan from Pterocarpus santalinus inhibits tumor necrosis factor-alpha production and T cell proliferation." Database accession no. PREV200100195141 XP002253893 Zusammenfassung & BIOLOGICAL & PHARMACEUTICAL BULLETIN, Bd. 24, Nr. 2, Februar 2001 (2001-02), Seiten 167-171, ISSN: 0918-6158 ---	1,6,8
A	KR 271 743 B (HAN BYUNG HOON) 18. August 2000 (2000-08-18) Zusammenfassung -----	1,6,8

# INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 03/05347

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
RO 116865	B	30-07-2001	KEINE	
RO 117295	B	30-01-2002	KEINE	
WO 02092030	A	21-11-2002	ES 2176124 A1 WO 02092030 A1	16-11-2002 21-11-2002
US 5962517	A	05-10-1999	KEINE	
JP 05286835	A	02-11-1993	JP 3014214 B2	28-02-2000
JP 2977648	B	25-01-1994	JP 2977648 B2 JP 6016525 A	15-11-1999 25-01-1994
JP 1255639	A	21-09-1999	KEINE	
JP 2001322940	A	20-11-2001	KEINE	
JP 2001278769	A	10-10-2001	KEINE	
JP 2001139429	A	22-05-2001	KEINE	
JP 11263718 9	A		KEINE	
JP 10072336 9	A		KEINE	
JP 7025740	A	27-01-1995	KEINE	
JP 60214721 9	A		KEINE	
JP 10072336	A	17-03-1998	JP 2003176208 A	24-06-2003
KR 271743	B	15-11-2000	KR 271743 B1	15-11-2000